Cited documents:

US4988818 WO9740009

WO9835935 WO9842683

JP10158254

ACRYRONITRILE-BASED COMPOUND, METHOD FOR PRODUCING THE SAME AND PEST CONTROLLING AGENT COMPRISING THE SAME

Patent number:

WO9944993

Publication date:

1999-09-10

Inventor:

KOYANAGI TORU (JP); NAKAMURA YUJI (JP);

MORITA MASAYUKI (JP); IKEDA TSUYOSHI (JP)

Applicant:

ISHIHARA SANGYO KAISHA (JP); KOYANAGI TORU (JP); NAKAMURA YUJI (JP); MORITA MASAYUKI (JP);

IKEDA TSUYOSHI (JP)

Classification:

- international:

A01N47/06; C07D231/12; A01N47/02; C07D231/00;

(IPC1-7): C07D231/12; A01N43/56; A01N43/80;

C07D231/16; C07D231/20; C07D233/64; C07D233/68; C07D261/08; C07D261/10; C07D263/32; C07D263/34; C07D275/02; C07D275/03; C07D277/24; C07D277/32;

C07D403/12; C07D417/12

- european:

A01N47/06; C07D231/12

Application number: WO1999JP01047 19990304

Priority number(s): JP19980073125 19980306; JP19980242516 19980812

Report a data error here

Abstract of WO9944993

A novel compound which is useful as an active constituent of a pest controlling agent is provided. The compound is an acrylonitrile-based compound represented by formula (I), wherein Q is a substituted or unsubstituted phenyl or the like, X is a substituted or unsubstituted naphthyl or -J, Y is -C(=O)R1, -C(=S) R2 or the like, R1 is a substituted or unsubstituted alkynyl or -SR3, R2 is a substituted or unsubstituted alkyl or the like, R3 is a substituted or unsubstituted alkyl or the like, and J is a 5 or 6-membered heterocyclic group having 1 to 4 atoms of at least one heteroatom selected from the group consisting of O, S and N, with the proviso that X is not a pyridyl group, and a salt thereof.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

PCT

世界知的所有権機関 際 事 務 局 特許協力条約に基づいて公開された国際出願



(51) 国際特許分類6

C07D 231/12, 231/16, 231/20, 233/64, 233/68, 261/08, 261/10, 263/32, 263/34, 275/02, 275/03, 277/24, 277/32, 403/12, 417/12, A01N 43/56, 43/80

(11) 国際公開番号 A1

WO99/44993

(43) 国際公開日

1999年9月10日(10.09.99)

(21) 国際出願番号

PCT/JP99/01047

IP

(22) 国際出願日

1999年3月4日(04.03.99)

(30) 優先権データ

特願平10/73125

1998年3月6日(06.03.98)

特願平10/242516

1998年8月12日(12.08.98)

(71) 出願人(米国を除くすべての指定国について) 石原産業株式会社 (ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.)[JP/JP] 〒550-0002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目3番15号 Osaka, (JP)

(72) 発明者;および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ)

小柳 徹(KOYANAGL, Toru)[JP/JP]

中村裕治(NAKAMURA, Yuji)[JP/JP]

森田雅之(MORITA, Masayuki)[JP/JP]

池田 PMIKEDA, Tsuvoshi)[JP/JP]

〒525-0025 滋賀県草津市西波川二丁目3番1号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga, (JP)

(74) 代理人

弁理士 小川利春, 外(OGAWA, Toshiharu et al.) 〒101-0042 東京都千代田区神田東松下町38番地 鳥本鋼業ビル Tokyo, (JP)

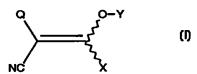
(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, UG, ZW)、ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)

添付公開書類

国際調査報告書

ACRYRONITRILE-BASED COMPOUND, METHOD FOR PRODUCING THE SAME AND PEST CONTROLLING (54) Title: AGENT COMPRISING THE SAME

(54)発明の名称 アクリロニトリル系化合物、それらの製造方法及びそれらを含有する有害生物防除剤

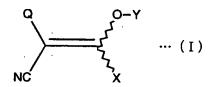


(57) Abstract

A novel compound which is useful as an active constituent of a pest controlling agent is provided. The compound is an acrylonitrilebased compound represented by formula (I), wherein Q is a substituted or unsubstituted phenyl or the like, X is a substituted or unsubstituted naphthyl or -J, Y is -C(=0)R₁, -C(=S)R₂ or the like, R₁ is a substituted or unsubstituted alkynyl or -SR₃, R₂ is a substituted or unsubstituted alkyl or the like, R3 is a substituted or unsubstituted alkyl or the like, and J is a 5 or 6-membered heterocyclic group having 1 to 4 atoms of at least one heteroatom selected from the group consisting of O, S and N, with the proviso that X is not a pyridyl group, and a salt thereof.

(57)要約

有害生物防除剤の有効成分として有用な、新規化合物を提供する。 式(I);



〔式中、Qは置換されてもよいフェニルなどであり、Xは置換されてもよいナフチル又は一Jであり、Yは一C(=O) R_1 、-C(=S) R_2 などであり、 R_1 は置換されてもよいアルキニル又は $-SR_3$ であり、 R_2 は置換されてもよいアルキルなどであり、 R_3 は置換されてもよいアルキルなどであり、IはO、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種のヘテロ原子を1~4含有する5若しくは6 員複素環基などであり、但しXはピリジル基を含まない〕で表されるアクリロニトリル系化合物又はその塩。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

1

明細書

アクリロニトリル系化合物、それらの製造方法及びそれらを含有する有害生物防除剤 技術分野

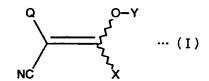
本発明は、有害生物防除剤の有効成分として有用な新規アクリロニトリル系化合物に 関する。

背景技術

- (1)米国特許第 3,337,565 号公報及び米国特許第 3,337,566 号公報には本発明化合物と 類似したアクリロニトリル誘導体が記載されているが、該誘導体と本発明化合物は化学 構造を異にする。
- (2)WO97/40009 号公報には本発明化合物と類似したエチレン誘導体が記載されているが、該誘導体と本発明化合物は化学構造を異にする。
- (3)WO98/42683 号公報には本発明化合物と類似したトリアゾール化合物が記載されているが、該化合物と本発明化合物は化学構造を異にする。

発明の開示

本願発明者等は、優れた有害生物防除剤を見出すべくアクリロニトリル系化合物に 注目して種々検討した結果、本発明を完成した。すなわち本発明は、式(I);



〔式中、Qは置換されてもよいフェニル、置換されてもよいベンジル、置換されてもよいナフチル又は一Jであり、Xは置換されてもよいナフチル又は一Jであり、Yはアルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、一C (=O) R_1 又は-C (=S) R_2 であり、 R_1 は置換されてもよいアルキニル又は-S R_3 であり、 R_2 は置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルキール、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいアルカーシ、置換されてもよいアルカーシ、置換されてもよいアルケニルオキシ、置換されてもよいアルケニルチオ、置換されてもよいアルキニルチオ、置換されてもよいアルキニルチオ、置換されてもよいアルキールチオ、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよ

いシクロアルキルオキシ、置換されてもよいシクロアルキルチオ、置換されてもよいフェール、置換されてもよいフェノキシ、置換されてもよいフェニルチオ、置換されてもよいベンジル、置換されてもよいベンジルオキシ、置換されてもよいベンジルチオ、一J、一〇一J又は一S一Jであり、R3は置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルキール、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいベンジル又は一Jであり、Jは〇、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~4含有する5若しくは6員複素環基(複素環基は置換されていてもよい)又は〇、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~10含有する6~11員縮合複素環基(縮合複素環基は置換されていてもよい)であり、但しXはピリジル基を含まない」で表されるアクリロニトリル系化合物又はその塩、それらの製造方法並びにそれらを含有する有害生物防除剤に関する。

式(I)中、R₁の置換されてもよいアルキニル、R₂の置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいアルカニルを置換されてもよいアルキニルオキシ、置換されてもよいアルキニルオキシ、置換されてもよいアルキニルオキシ、置換されてもよいアルキールチオ並びにR₃の置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル及び置換されてもよいアルキニルのその置換基としては、例えばハロゲン、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、ニトロ、シアノ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルコキシカルボニルなどが挙げられる。置換数は1又は2以上であってもよく、2以上の場合、それらは同一でも相異なってもよい。

Qの置換されてもよいフェニル、置換されてもよいベンジル及び置換されてもよいナフチル、Xの置換されてもよいナフチル、R₂の置換されてもよいフェニル、置換されてもよいフェノキシ、置換されてもよいフェニルチオ、置換されてもよいベンジル、置換されてもよいベンジルオキシ及び置換されてもよいベンジルチオ、R₃の置換されてもよいベンジル並びにJの複素環基及び縮合複素環基のその置換基としては、例えばハ

ロゲン、W₁で置換されてもよいアルキル、W₁で置換されてもよいアルコキシ、W₁で 置換されてもよいアルキルチオ、W₁で置換されてもよいアルキルスルフィニル、W₁ で置換されてもよいアルキルスルホニル、ニトロ、シアノ、アミノ、モノアルキルアミ ノ、ジアルキルアミノ、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、 シクロアルキル、 W_2 で置換されてもよいフェニル、 W_2 で置換されてもよいフェノキ シ、 W_2 で置換されてもよいベンジル、 W_2 で置換されてもよいピロリル、 W_2 で置換さ れてもよいフリル、W2で置換されてもよいチエニル、W2で置換されてもよいイミダ ゾリル、W2で置換されてもよいピラゾリル、W2で置換されてもよいオキサゾリル、 W₂で置換されてもよいイソオキサゾリル、W₂で置換されてもよいチアゾリル、W₂で 置換されてもよいイソチアゾリル、 W_2 で置換されてもよい 1, 2, 3 - トリアゾリル、 W_2 で置換されてもよい 1 、 2 、 4-トリアゾリル、 W_2 で置換されてもよい 1 、 2 、 3-オキサジアゾリル、 W_2 で置換されてもよい1, 2, 4-オキサジアゾリル、 W_2 で置換されてもよい1, 3, 4-オキサジアゾリル、W,で置換されてもよい1, 2, 3- チアジアゾリル、 W_2 で置換されてもよい 1 、 2 、 4- チアジアゾリル、 W_2 で置 換されてもよい1,3,4-チアジアゾリル、W₂で置換されてもよい1,2,3,4 ーテトラゾリル、W₂で置換されてもよいピリジル、W₂で置換されてもよいピリミジ $- \mu$ 、 W_2 で置換されてもよいピラジニル、 W_2 で置換されてもよいピリダジニル、 W_3 で置換されてもよい 1 、 2 、 4- トリアジニル、 W_2 で置換されてもよい 1 、 3 、 5-トリアジニル、W2で置換されてもよい 1, 2, 3, 5ーテトラジニル、W2で置換さ れてもよい1,2,4,5ーテトラジニル、W₂で置換されてもよいイミダゾリニル、 W2で置換されてもよいピラゾリニル、W2で置換されてもよいオキサゾリニル、W2で 置換されてもよいイソオキサゾリニル、 W_2 で置換されてもよいチアゾリニル、 W_2 で 置換されてもよいイソチアゾリニル、 W_2 で置換されてもよい 1 - 2 ロリジニル、 W_2 で置換されてもよい1-ピペリジニル、W₂で置換されてもよい4-モルホリノ、W" で置換されてもよいインドリル、W₂で置換されてもよいベンゾフラニル、W₂で置換 されてもよいイソベンゾフラニル、 W_2 で置換されてもよいベンゾチエニル、 W_2 で置 換されてもよいベンゾイミダゾリル、 W_2 で置換されてもよいインダゾリル、 W_2 で置

換されてもよいベンゾオキサゾリル、 W_2 で置換されてもよいベンゾイソキサゾリル、 W_2 で置換されてもよいベンゾチアゾリル、 W_2 で置換されてもよいベンゾイソチアゾリル、 W_2 で置換されてもよいインキノリル、 W_2 で置換されてもよいインキノリル、 W_2 で置換されてもよいフタラジル、 W_2 で置換されてもよいキナザリニル、 W_2 で置換されてもよいキノキサリニル、アシル、アルコキシカルボニルなどが挙げられる。置換数は 1 又は 2 以上であってもよく、2 以上の場合、それらは同一でも相異なってもよい。 W_1 はハロゲン、アルコキシ、アルキルチオ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、フェニル、シクロアルキル、アルコキシカルボニル、トリアルキルシリル又はシアノである。 W_2 はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、フェニル、テルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、フェニル、ニトロ又はシアノである。

R₂の置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいシクロアルキルオキシ及び置換されてもよいシクロアルキルチオ並びにR₃の置換されてもよいシクロアルキルのその置換基としては、例えばハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シアノなどが挙げられる。置換数は1又は2以上であってもよく、2以上の場合、それらは同一でも相異なってもよい。

Jの複素環基としては、例えばピロリル、フリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3ートリアゾリル、1, 2, 3ーオキサジアゾリル、1, 2, 4ートリアゾリル、1, 2, 3ーオキサジアゾリル、1, 2, 3ーチアジアゾリル、1, 2, 4ーチアジアゾリル、1, 2, 3ーチアジアゾリル、1, 2, 4ーチアジアゾリル、1, 2, 4ーテトラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、1, 2, 4ートリアジニル、1, 3, 5ートリアジニル、1, 2, 3, 5ーテトラジニル、1, 2, 4, 5ーテトラジニル、イミダゾリニル、ピラゾリニル、オキサゾリニル、イソオキサゾリニル、チアゾリニル、イソチアゾリニル、1ーピロリジニル、1ーピペリジニル、4ーモルホリノなどが挙げられ、縮合複素環基としては、例えばインドリル、ベンゾフラニル、イ

5

ソベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾオキ サゾリル、ベンゾイソキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、キノリ ル、イソキノリル、シンノリル、フタラジル、キナザリニル、キノキサリニルなどが挙 げられる。

- 式(I)中、R₂又はR₃に含まれるアルキル又はアルキル部分或いはQ、X、R₁、R₂、R₃又はJに含まれる置換基としてのアルキル又はアルキル部分としては、炭素数が $1\sim6$ で直鎖状又は分枝状のもの、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシルなどが挙げられる。Y、R₁、R₂又はR₃に含まれるアルケニル、アルキニル、アルケニル部分又はアルキニル部分或いはQ、X、R₂、R₃又はJに含まれる置換基としてのアルケニル、アルケニル部分、アルキニル又はアルキニル部分としては、炭素数が $2\sim6$ で直鎖状又は分枝状のもの、例えばビニル、アリル、ブタジエニル、イソプロペニル、エチニル、プロピニル、2-ペンテン-4-1になどが挙げられる。R₂又はR₃に含まれるシクロアルキル又はシクロアルキル部分或いはQ、X、R₂、R₃又はJに含まれる置換基としてのシクロアルキルとしては、炭素数が $3\sim6$ のもの、例えばシクロプロピル、シクロペンチル、シクロペンチル、シクロペンチル、シクロペンチル、シクロペンチル、シクロペンチンルなどが挙げられる。
- 式(I)中、Yに含まれる置換基としてのハロゲン或いはQ、X、 R_1 、 R_2 、 R_3 又はJに含まれる置換基としてのハロゲンとしては、弗素、塩素、臭素又は沃素の各原子が挙げられ、置換基としてのハロゲンの置換数は1又は2以上であってもよく、2以上の場合、それらは同一でも相異なってもよい。
- 式(I)のアクリロニトリル系化合物は、塩を形成することが可能であり、その塩としては農業上許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩;酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。
- 式(I)のアクリロニトリル系化合物には、幾何異性体(E体及びZ体)が存在するが、本発明においては、これら各異性体及びこれらの混合物を全て包含する。また、置換基の種類によっては光学異性体が存在するが、本発明においては、これら各異性体及

6

びこれらの混合物を全て包含する。

- 式(I)のアクリロニトリル系化合物又はその塩の中で望ましい化合物は、以下の通りである。
- [a] Jの複素環基がピロリル、フリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3ートリアゾリル、1, 2, 4ートリアゾリル、1, 2, 3ーオキサジアゾリル、1, 2, 4ーオキサジアゾリル、1, 3, 4ーオキサジアゾリル、1, 2, 3ーチアジアゾリル、1, 2, 4ーテトラゾリル、1, 2, 4ーチアジアゾリル、1, 3, 4ーチアジアゾリル、1, 2, 3, 4ーテトラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、1, 2, 4ートリアジニル、1, 3, 5ートリアジニル、1, 2, 3, 5ーテトラジニル、インオキサゾリニル、チアゾリニル、オキサゾリニル、イソオキサゾリニル、チアゾリニル、インチアゾリニル、1ーピロリジニル、1ーピペリジニル又は4ーモルホリノであり、縮合複素環基がインドリル、ベンゾフラニル、インベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾイミダゾリル、インダブリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソキサゾリル、ベンブチアゾリル、ベンゾイアチブリル、ベンブイソチアゾリル、インキノリル、シンノリル、フタラジル、キナザリニル又はキノキサリニルである前記式(I)のアクリロニトリル系化合物又はその塩。
- [b] Qが置換されてもよいフェニル又は一Jであり、Xが一Jであり、Yが一C(=O)R₁又は一C(=S)R₂であり、R₁が置換されてもよいアルキニル又は一SR₃であり、R₂が置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルケニルオキシ、置換されてもよいアルキニルオキシ、置換されてもよいアルキルチオ、置換されてもよいアルキールチオ、置換されてもよいアルキールチオ、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいシクロアルキルメキシ、置換されてもよいシクロアルキルチオ、置換されてもよいフェニル、置換されてもよいフェニルチオ、置換されてもよいブェニル、置換されてもよいベンジルオキシ、置換されてもよいベンジルチオ、一J、一〇一J又は一S一Jであり、R₃が置換されてもよいアルキ

ル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいベンジル又は一Jであり、Jが〇、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~4含有する5若しくは6員複素環基(複素環基は置換されていてもよい)又は〇、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~10含有する6~11員縮合複素環基(縮合複素環基は置換されていてもよい)である前記式(I)のアクリロニトリル系化合物又はその塩。

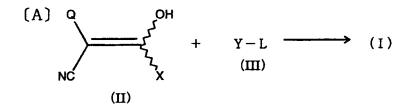
- [c] Jの複素環基がピロリル、フリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサブリル、チアゾリル、イソチアブリル、1, 2, 3ートリアブリル、1, 2, 4ートリアブリル、1, 2, 3ーオキサジアブリル、1, 2, 4ーオキサジアブリル、1, 3, 4ーオキサジアブリル、1, 2, 3ーチアジアブリル、1, 2, 4ーテトラブリル、2, 4ーチアジアブリル、1, 3, 4ーチアジアブリル、1, 2, 4ートリアジニル、ピリジル、ピリジール、ピラジニル、ピリダジニル、1, 2, 4ートリアジニル、1, 3, 5ートリアジニル、1, 2, 3, 5ーテトラジニル、1, 2, 4, 5ーテトラジニル、イミダブリニル、ピラブリニル、オキサブリニル、イソオキサブリニル、チアブリニル、インチアブリニル、1ーピロリジニル、1ーピペリジニル又は4ーモルホリノであり、縮合複素環基がインドリル、ベンブフラニル、イソベンブフラニル、ベンブチエニル、ベンブイミダブリル、インダブリル、ベンブオキサブリル、ベンブイソキサブリル、ベンブチアブリル、ベンブイソチアブリル、マンブナアブリル、マンブナアブリル、シンノリル、フタラジル、キナザリニル又はキノキサリニルである前記[b]の化合物又はその塩。
- 【d】Qが置換されてもよいフェニル、置換されてもよいイミダゾリル、置換されてもよいピラゾリル、置換されてもよいオキサゾリル、置換されてもよいイソオキサゾリル、置換されてもよいチアゾリル又は置換されてもよいイソチアゾリルであり、Xが置換されてもよいイミダゾリル、置換されてもよいピラゾリル、置換されてもよいオキサゾリル、置換されてもよいイソオキサゾリル、置換されてもよいチアゾリル又は置換されてもよいイソチアゾリルであり、Yが一C(=O)R₁又は一C(=S)R₂であり、R₁が置換されてもよいアルキニル又は一SR₃であり、R₂が置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいア

ルコキシ、置換されてもよいアルケニルオキシ、置換されてもよいアルキニルオキシ、置換されてもよいアルキルチオ、置換されてもよいアルケニルチオ、置換されてもよいシクロアルキル 大キシ、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいフェニル、置換されてもよいフェニル、置換されてもよいフェニル、置換されてもよいフェニル、置換されてもよいベンジル、置換されてもよいベンジルオキシ、置換されてもよいベンジルオキシ、置換されてもよいベンジルオキン、置換されてもよいベンジルチオ、一J、一〇一J又は一S一Jであり、R3が置換されてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいベンジル又は一Jであり、Jが〇、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~4含有する5若しくは6員複素環基(複素環基は置換されていてもよい)又は〇、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~4合有する5若しくは6員複素環基(複素環基は置換されていてもよい)アルウリロートリル系化合物又はその塩。

- [e] Qが置換されてもよいフェニルである前記 [d] の化合物又はその塩。
- 【f】Jの複素環基がピロリル、フリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3ートリアゾリル、1, 2, 4ーオキサジアゾリル、1, 2, 4ーオキサジアゾリル、1, 2, 4ーオキサジアゾリル、1, 3, 4ーオキサジアゾリル、1, 2, 3ーチアジアゾリル、1, 2, 4ーテトラゾリル、2, 4ーチアジアゾリル、1, 3, 4ーチアジアゾリル、1, 2, 4ートリアジニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、1, 2, 4ートリアジニル、1, 3, 5ートリアジニル、ピラジニル、ピリダジニル、1, 2, 4, 5ーテトラジニル、イミダゾリニル、ピラゾリニル、オキサゾリニル、イソオキサゾリニル、チアゾリニル、イソチアゾリニル、1ーピロリジニル、1ーピペリジニル又は4ーモルホリノであり、縮合複素環基がインドリル、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾイミダブリル、インダブリル、ベンゾオキサブリル、ベンブイソキサブリル、ベンブチアゾリル、ベンブイソチアゾリル、ベンブイソナアゾリル、ベンブチアゾリル、ベンブイソナアゾリル、ジンノリル、フタラジル、キナザリニル又はキノキサリニルである前記〔d〕又は〔e〕の化合物又

はその塩。

式(I)のアクリロニトリル系化合物又はその塩(以下本発明化合物と略す)は、例えば反応 [A]、[B] 並びに通常の塩の製造方法に従って製造することができる。



反応 $\{A\}$ について、以下に記述する。反応 $\{A\}$ 中、Q、X、Y及 \mathcal{C} 式 $\{I\}$ は前述の通りであり、 $\{L\}$ はハロゲンである。

反応〔A〕は、通常塩基の存在下で行われる。塩基としては、例えばナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属;カリウム tert-ブトキシドのようなアルカリ金属のアルコレート;炭酸カリウム、炭酸ナトリウムのような炭酸塩;重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウムのような重炭酸塩;水酸化カリウム、水酸化ナトリウムのような金属水酸化物;水素化カリウム、水素化ナトリウムのような金属水素化物;トリメチルアミン、トリエチルアミン、ピリジン、4ージメチルアミノピリジンのような第3級アミン類などから1種又は2種以上が適宜選択される。

反応〔A〕は、必要に応じて溶媒の存在下で行われる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類;四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような環状又は非環状脂肪族炭化水素類;ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類;ジメチルスルホキシド、スルホラン、N,Nージメチルアセトアミド、N,Nージメチルホルムアミド、Nーメチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒;アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類;アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類;トリメチルアミン、トリエチルアミンのような第3級アミン類;水などから1種又は2種以上が適宜選択される。

反応 [A] の反応温度は、通常-80~+150℃、望ましくは-50~+120℃ であり、反応時間は、通常0.1~48時間、望ましくは0.2~24時間である。

式 (I) 中、Yが-C (=O) R,Zは-C (=S) R,である場合

(B)
$$(II) + CI-T-CI \xrightarrow{\text{$\frac{1}{2}}} Q \xrightarrow{\text{$O-T-CI$}} X$$
 (V)

$$(V) + G-R, \qquad \xrightarrow{\text{$\frac{92}{4}$}} \qquad \underbrace{}^{Q} \qquad \underbrace{}^{O-T-R}, \qquad \underbrace{}^{X} \qquad \underbrace{}^{(I-1)}$$

反応 [B] について、以下に記述する。反応 [B] 中、Q、X 及び式 (II) は前述の通りであり、T は-C (=O) - 又は-C (=S) - であり、G は水素、N a、L i、M g B r、M g C l 又はM g I であり、R $_4$ はR $_1$ 又はR $_2$ (R $_1$ 及びR $_2$ は前述の通り)である。

反応 [B] の第1工程は、必要に応じて塩基の存在下で行われる。塩基としては、例 えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ピリジン、4ージメチルアミノピリジンの ような第3級アミン類などから1種又は2種以上が適宜選択される。

反応 [B] の第1工程は、通常溶媒の存在下で行われる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類;四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような環状又は非環状脂肪族炭化水素類;ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類などから1種又は2種以上が適宜選択される。

反応 [B] の第1工程の反応温度は、通常-80~+150℃、望ましくは-50~ +80℃であり、反応時間は、通常0.1~48時間、望ましくは0.5~24時間で ある。

反応 [B] の第1工程によって調製される式 (V) で表される化合物は、本発明における有用な新規中間体化合物である。

反応 [B] の第2工程は、必要に応じて塩基の存在下で行われる。塩基としては、例 えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウムのような炭酸塩;トリメチルアミン、トリエチルア ミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジンのような第3級アミン類などから1種又 は2種以上が適宜選択される。

反応 [B] の第2工程は、通常溶媒の存在下で行われる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類;四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような環状又は非環状脂肪族炭化水素類;ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類;アセトニトリル、プロピオニトリル、アクリロニトリルのようなニトリル類;アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類などから1種又は2種以上が適宜選択される。

反応〔B〕の第2工程の反応温度は、通常-80~+150℃、望ましくは-80~+80℃であり、反応時間は、通常0.1~48時間、望ましくは0.5~24時間である。

前記反応 [A] 及び [B] 中の式 (II) で表される化合物は、本発明化合物を製造する際に有用な中間体化合物であり、その中には新規化合物が含まれている。

式(II)の化合物は、塩を形成することが可能であり、その塩としては農業上許容されるものであればあらゆるものが含まれるが、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩;酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩;ナトリウム塩、カリウム塩のようなアルカリ金属塩;マグネシウム塩、カルシウム塩のようなアルカリ土類金属塩;ジメチルアンモニウム、トリエチルアンモニウムのような第4級アンモニウム塩;などが挙げられる。

式(II)の化合物には、幾何異性体(E体及び2体)が存在するが、本発明におい

ては、これら各異性体及びこれらの混合物を全て包含する。また式 (II) の化合物は、式;



で表される互変異性体として存在することができ、Q又はXがN原子を2以上含有する 複素環基又は縮合複素環基である場合は、式;

で表される互変異性体として存在することができるが、本発明においては、これら各異性体及びこれらの混合物を全て包含する。さらに、式(II)の化合物には、光学異性体が存在するが、本発明においては、これら各異性体及びこれらの混合物を全て包含する。

式(II)の化合物には有害生物防除活性を示すものが含まれている。

式(II)の化合物又はその塩は、例えば反応[C]並びに通常の塩の製造方法に従って製造することができる。

反応〔C〕について、以下に記述する。反応〔C〕中、Q、X及び式(II) は前述の通りであり、Zはハロゲン又はアルコキシである。

反応〔C〕は、通常塩基及び溶媒の存在下で行なわれる。

塩基としては、例えばナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属;ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウム tert-ブトキシドのようなアルカリ金属のアルコレート;水素化カリウム、水素化ナトリウムのような金属水素化物;メチルリチウム、ローブチルリチウム、 tert-ブチルリチウム、フェニルリチウムのような有機リチウム;炭酸カリウム、炭酸ナトリウムのような炭酸塩;重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウムのような重炭酸塩;水酸化カリウム、水酸化ナトリウムのような金属水酸化物;モ

ノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類;ピリジン、4 ージメチルアミノピリジンのようなピリジン類などから1種又は2種以上が適宜選択される。

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類;ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテルのようなエーテル類;メタノール、エタノール、プロパノール、tert-ブタノールのようなアルコール類;四塩化炭素、塩化メチル、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ヘキサン、シクロヘキサンのような環状又は非環状脂肪族炭化水素類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類;ジメチルスルホキシド、スルホラン、 N, Nージメチルアセトアミド、 N, Nージメチルホルムアミド、Nーメチルピロリドン、ピリジンのような極性非プロトン性溶媒;アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類;モノメチルアミン、ジメチルアミン、トリエチルアミンのようなアミン類;水などから1種又は2種以上が適宜選択される。

反応〔C〕の反応温度は、通常-80~+150℃、望ましくは-50~+120℃ であり、反応時間は、通常0.1~48時間、望ましくは0.5~24時間である。

反応 [C] において、Zがハロゲンである場合、式 (VII)と式 (VIII) とを反応させた後、必要に応じて加水分解反応を行なう。目的物である式 (II) の収率を向上させる為には、この加水分解反応を行なうことが望ましい。

前記反応 [C] 中の式 (VII)で表される化合物は、WO97/40009 号公報、特にその 85 ~86 頁に記載された方法又はそれに準じた方法により製造することができる。

本発明化合物は、有害生物防除剤の有効成分として有用である。特に殺虫剤、殺ダニ 剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、水中付着生物防除剤などのような有害生物防除 剤の有効成分として有用である。

本発明化合物を含有する有害生物防除剤の望ましい態様について以下に記述する。まず、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤のごとき有害生物防除剤について記述する。

本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、殺虫、殺ダニ、殺線虫、殺土壌害虫剤(以 下殺害虫剤と略す)として有用であるが、例えば、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カン ザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、チャノホコリダニ、ミカンサビダニ、ネダ ニなどのような植物寄生性ダニ類;マダニ類などのような動物寄生性ダニ類;モモアカ アブラムシ、ワタアブラムシのようなアブラムシ類、コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨ トウ、コドリンガ、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コブノメイガ、 チャノコカクモンハマキ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、ウンカ類、 ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類、アザミウマ類、バッタ類、 ハナバエ類、コガネムシ類、タマナヤガ、カブラヤガ、アリ類などのような農業害虫類; ネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシンガレセン チュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウなどのような植物寄生性線虫類; ナメクジ、マイマイなどのような腹足類:ダンゴムシ、ワラジムシのような等脚類など のような土壌害虫類;イエダニ、ゴキブリ類、イエバエ、アカイエカなどのような衛生 害虫類;バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類などのような 貯穀害虫類;イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類などのような衣類、家屋害虫類; ケナガコナダニ、コナヒョウダニ、ミナミツメダニのような屋内塵性ダニ類;その他家 畜などに寄生するノミ類、シラミ類、ハエ類などの防除に有効である。なかでも、本発 明化合物を含有する殺害虫剤は、植物寄生性ダニ類、動物寄生性ダニ類、農業害虫類、 衛生害虫類、衣類、家屋害虫類、屋内塵性ダニ類などの防除に特に有効である。また、 本発明化合物を含有する殺害虫剤は、有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド 剤などの薬剤に対する各種抵抗性害虫の防除にも有効である。さらに本発明化合物は、 優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を含有する殺害虫剤を土壌に処 理することによって土壌有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、等脚類の防除と同時に 茎葉部の害虫類をも防除することができる。

また、本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、殺菌剤として有用であるが、例えばイネのいもち病、紋枯病、ごま葉枯病;ムギ類のうどんこ病、赤かび病、さび病、雪腐病、裸黒穂病、眼紋病、葉枯病、ふ枯病;カンキツの黒点病、そうか病;リンゴのモ

ニリア病、うどんこ病、斑点落葉病、黒星病;ナシの黒星病、黒斑病;モモの灰星病、 黒星病、フォモプシス腐敗病;ブドウの黒とう病、晩腐病、うどんこ病、べと病;カキ の炭そ病、落葉病;ウリ類の炭そ病、うどんこ病、つる枯病、べと病;トマトの輪紋病、 葉かび病、疫病;アブラナ科野菜の黒斑病;ジャガイモの夏疫病、疫病;イチゴのうど んこ病;種々の作物の灰色かび病、菌核病;などの病害の防除に有効であり、更にはフ ザリウム菌、ピシウム菌、リゾクトニア菌、バーティシリウム菌、プラズモディオホー ラ菌などの植物病原菌によって引き起こされる土壌病害の防除ににも有効である。

本発明化合物を含有する有害生物防除剤の別の望ましい態様としては、前記した植物 寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類、腹足類、土壌害虫類、各種病害、各種 土壌病害などを総合的に防除する農園芸用の有害生物防除剤が挙げられる。

本発明化合物を含有する殺害虫剤、殺菌剤のごとき有害生物防除剤は、通常該化合物 と各種農業上の補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油 性懸濁剤、水溶剤、乳剤、ペースト剤、エアゾール剤、微量散布剤などの種々の形態に 製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられて いるあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、 消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオ リナイト及びセリサイトの混合物、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、 澱粉などの固型担体;水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセ トン、イソホロン、メチルイソプチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメ チルスルホキシド、 N, Nージメチルホルムアミド、 N, Nージメチルアセトアミド、 N-メチル-2-ピロリドン、アルコールなどの溶剤;脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキ ルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸 エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテ ル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスル ホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテ ルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキル アリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル

硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエ チレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテ ルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスル ホン酸ホルマリン縮合物の塩のような陰イオン系の界面活性剤や展着剤;ソルビタン脂 肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコー ルポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシア ルキレンブロックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレ ンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルアリールエーテル、ポリオ キシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリ オキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エス テル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのよう な非イオン系の界面活性剤や展着剤;オリーブ油、カポック油、ひまし油、シュロ油、 椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種 油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィンなどの植物油や鉱物油などが挙げられる。これ ら補助剤は本発明の目的から逸脱しないかぎり、当該分野で知られたものの中から選ん で用いることができる。また、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、 薬害軽減剤、防黴剤など通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化 合物と各種補助剤との配合割合は0.001:99.999~95:5、望ましくは0. 005:99.995~90:10である。これらの製剤の実際の使用に際しては、そ のまま使用するか、または水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤 を添加して使用することができる。

本発明化合物を含有する殺害虫剤、殺菌剤のごとき有害生物防除剤の施用は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に0.05~80000ppm、望ましくは0.5~50000ppmの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用量は、1~クタール当り本発明化合物が0.05~1000g、望ましくは1~5000gである。本発明化合物を含有する有害生物防除剤の望ましい態様である殺害虫剤の施用は、前述と同様

各種条件の相違により一概に規定できないが、一般に0.1~500000ppm、望ましくは1~100000ppmの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用量は、1へクタール当り本発明化合物が0.1~10000g、望ましくは10~1000gであり、殺菌剤の施用は、前述と同様各種条件の相違により一概に規定できないが、一般に0.1~50000ppm、望ましくは1~10000ppmの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用量は、1へクタール当り本発明化合物が0.1~10000g、望ましくは10~1000gである。さらに、本発明化合物を含有する有害生物防除剤の別の望ましい態様である農園芸用の有害生物防除剤の施用は、前記殺害虫剤と殺菌剤の施用に準じて行われる。本発明には、このような施用方法による有害病害虫の防除方法も含まれる。

本発明化合物を含有する殺害虫剤、殺菌剤のごとき有害生物防除剤の種々の製剤、またはその希釈物の施用は、通常一般に行なわれている施用方法すなわち、散布(例えば散布、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粒、水面施用等)、土壌施用(混入、潅注等)、表面施用(塗布、粉衣、被覆等)、浸漬毒餌等により行うことができる。また、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害昆虫の発生生育を防除することも可能である。またいわゆる超高濃度少量散布法(ultralow volume)により施用することもできる。この方法においては、活性成分を 100%含有することが可能である。

また、本発明化合物を含有する殺害虫剤、殺菌剤のごとき有害生物防除剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤などと混用或は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウィルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモン、植物成長調整剤などが挙げられる。特に、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物の1種又は2種以上とを混用或は併用した混合有害生物防除組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような混合有害生物防除組成物も含ま

れる。

本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物との混合比は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に1:300~300:1、望ましくは1:100~100:1である。また、施用適量は1へクタール当りの総有効成分化合物量として0.1~5000g、望ましくは10~3000gである。本発明には、このような混合有害生物防除組成物の施用方法による有害病害虫の防除方法も含まれる。

上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌害虫剤、すなわち殺害虫剤の有効成分化合物(一般名;一部申請中を含む)としては、例えばプロフェノホス(Profenofos)、ジクロルボス(Dichlorvos)、フェナミホス(Fenamiphos)、フェニトロチオン(Fenitrothion)、EPN、ダイアジノン(Diazinon)、クロルピリホスメチル(Chlorpyrifosーmethyl)、アセフェート(Acephate)、プロチオホス(Prothiofos)、ホスチアゼート(Fosthiazate)、ホスホカルブ(Phosphocarb)のような有機リン酸エステル系化合物;

カルバリル (Carbaryl)、プロポキスル (Propoxur)、アルジカルブ (Aldicarb)、カルボフラン (Carbofuran)、チオジカルブ (Thiodicarb)、メソミル (Methomyl)、オキサミル (Oxamyl)、エチオフェンカルブ (Ethiofencarb)、ピリミカルブ (Pirimicarb)、フェノブカルブ (Fenobucarb) のようなカーバメート系化合物;

カルタップ (Cartap)、チオシクラム (Thiocyclam) のようなネライストキシン誘導体;

ジコホル (Dicofol)、テトラジホン (Tetradifon) のような有機 塩素系化合物;

酸化フェンプタスズ (Fenbutatin Oxide) のような有機金属系化合物;

フェンパレレート (Fenvalerate)、ペルメトリン (Permethri

n)、シペルメトリン (Cypermethrin)、デルタメトリン (Deltame thrin)、シハロトリン (Cyhalothrin)、テフルトリン (Tefluthrin)、エトフェンプロックス (Ethofenprox) のようなピレスロイド系化合物;

ジフルベンズロン (Diflubenzuron)、クロルフルアズロン (Chlorfluazuron)、テフルベンズロン (Teflubenzuron)、ノバルロン (Novaluron) のようなベンゾイルウレア系化合物;

メトプレン (Methoprene) のような幼若ホルモン様化合物;

ピリダベン (Pyridaben) のようなピリダジノン系化合物;

フェンピロキシメート (Fenpyroximate)、フィプロニル (Fipronil)、テブフェンピラド (Tebufenpyrad) のようなピラゾール系化合物;

イミダクロプリド (Imidacloprid)、ニテンピラム (Nitenpyram)、アセタミプリド (Acetamiprid)、ジアクロデン (Diacloden)、チアクロプリド (Thiacloprid) などのネオニコチノイド;

テプフェノジド (Tebufenozide)、メトキシフェノジド (Methoxyfenozide)、クロマフェノジド (Chromafenozide) などのヒドラジン系化合物;

ジニトロ系化合物、有機硫黄化合物、尿素系化合物、トリアジン系化合物、ヒドラゾン系化合物また、その他の化合物として、ププロフェジン(Buprofezin)、ヘキシチアゾクス(Hexythiazox)、アミトラズ(Amitraz)、クロルジメホルム(Chlordimeform)、シラフルオフェン(Silafluofen)、トリアザメイト(Triazamate)、ピメトロジン(Pymetrozine)、ピリミジフェン(Pyrimidifen)、クロルフェナピル(Chlorfenapyr)、インドキサカルブ(Indoxacarb)、アセキノシル(Acequinocyl)、エトキサゾール(Etoxazole)、シロマジン(Cyromazine)のような化合物;などが挙げられる。更に、BT剤、昆虫病原ウイルス剤な

どのような微生物農薬、アベルメクチン(Avermectin)、ミルベマイシン(Milbemycin)、スピノサッド(Spinosad)のような抗生物質などと、 混用、併用することもできる。

上記他の農薬中の、殺菌剤の有効成分化合物(一般名;一部申請中を含む)としては、例えば、メパニピリム(Mepanipyrim)、ピリメサニル(Pyrimethanil)、シプロジニル(Cyprodinil)のようなピリミジナミン系化合物;トリアジメホン(Triadimefon)、ビテルタノール(Bitertanol)、トリフルミゾール(Triflumizole)、エタコナゾール(Etaconazole)、プロピコナゾール(Propiconazole)、ペンコナゾール(Penconazole)、フルシラゾール(Flusilazole)、マイクロブタニル(Myclobutanil)、シプロコナゾール(Cyproconazole)、ターブコナゾール(Terbuconazole)、ヘキサコナゾール(Hexaconazole)、ファーコナゾールシス(Furconazoleーcis)、プロクロラズ(Prochloraz)、メトコナゾール(Metconazole)、エポキシコナゾール(Epoxiconazole)、テトラコナゾール(Tetraconazole)のようなアゾール系化合物;

キノメチオネート (Quinomethionate) のようなキノキサリン系化合物:

マンネブ (Maneb)、ジネブ (Zineb)、マンゼブ (Mancozeb)、ポリカーバメート (Polycarbamate)、プロピネブ (Propineb) のようなジチオカーバメート系化合物;

フサライド (Fthalide)、クロロタロニル (Chlorothalonil)、キントゼン (Quintozene) のような有機塩素系化合物;

ベノミル (Benomyl)、チオファネートメチル (Thiophanate-Methyl)、カーベンダジム (Carbendazim)、4ークロロー2ーシアノー 1ージメチルスルファモイルー5ー (4ーメチルフェニル) イミダゾールのようなイミダゾール系化合物; フルアジナム (Fluazinam) のようなピリジナミン系化合物;

シモキサニル(Cymoxanil)のようなシアノアセトアミド系化合物;

メタラキシル (Metalaxyl)、オキサジキシル (Oxadixyl)、オフレ ース (Ofurace)、ベナラキシル (Benalaxyl)、フララキシル (Fur alaxyl)、シプロフラム (Cyprofuram) のようなフェニルアミド系化 合物;

ジクロフルアニド(Dichlofluanid)のようなスルフェン酸系化合物; 水酸化第二銅(Cuprichydroxide)、有機銅(Oxine Copp er)のような銅系化合物;

ヒドロキシイソキサゾール(Hydroxyisoxazole)のようなイソキサ ゾール系化合物;

ホセチルアルミニウム (Fosetyl-Al)、トルコホスメチル (Tolcof os-Methyl)、S-ベンジル O, O-ジイソプロピルホスホロチオエート、 **O-エチル S,S-ジフェニルホスホロジチオエート、アルミニウムエチルハイドロ** ゲンホスホネートのような有機リン系化合物:

キャプタン(Captan)、キャプタホル(Captafol)、フォルペット(F olpet)のようなNーハロゲノチオアルキル系化合物;

プロシミドン (Procymidone)、イプロジオン (Iprodione)、ビ ンクロゾリン(Vinclozolin)のようなジカルボキシイミド系化合物;

フルトラニル (Flutolanil)、メプロニル (Mepronil) のような ベンズアニリド系化合物;

トリホリン(Triforine)のようなピペラジン系化合物;

ピリフェノックス(Pyrifenox)のようなピリジン系化合物;

フェナリモル (Fenarimol)、フルトリアフォル (Flutriafol) のようなカルビノール系化合物;

フェンプロピディン(Fenpropidine)のようなピペリジン系化合物; フェンプロピモルフ(Fenpropimorph)のようなモルフォリン系化合物; フェンチンヒドロキシド (Fentin Hydroxide)、フェンチンアセテート (Fentin Acetate) のような有機スズ系化合物;

ペンシキュロン(Pencycuron)のような尿素系化合物;

ジメトモルフ (Dimethomorph) のようなシンナミック酸系化合物;

ジエトフェンカルブ (Diethofencarb) のようなフェニルカーバメート 系化合物;

フルジオキソニル (Fludioxonil)、フェンピクロニル (Fenpiclonil) のようなシアノピロール系化合物;

アゾキシストロビン (Azoxystrobin)、クレソキシムメチル (Kresoxim-Methyl)、メトミノフェン (Metominofen) のような $\beta-$ メトキシアクリレート系化合物;

ファモキサドン (Famoxadone) のようなオキサゾリジノン系化合物;

アトラキノン系化合物;クロトン酸系化合物;抗生物質またその他の化合物として、イソプロチオラン (Isoprothiolane)、トリシクラゾール (Tricy clazole)、ピロキロン (Pyroquilon)、ジクロメジン (Diclom ezine)、プロベナゾール (Probenazole)、キノキシフェン (Quin oxyfen)、プロパモカルブ塩酸塩 (Propamocarb Hydrochloride)、スピロキサミン (Spiroxamine);などが挙げられる。

次に、水中付着生物防除剤のごとき有害生物防除剤について記述する。

本発明化合物を含有する水中付着生物防除剤は、船舶、水中構造物(例えば、港湾施設、ブイ、パイプライン、橋梁、海底基地、海底油田掘削設備、発電所の導水路管、定置網、養殖網など)に対する有害水中付着生物の防除、具体的には、緑藻や褐藻などのような植物類、フジツボ、セルプラ、ホヤ、イガイ、カキなどのような動物類、スライムと称される各種バクテリア、カビ、珪藻などのような水棲生物等の船舶の船底や水中構造物への付着及び繁殖防止に有効である。

本発明化合物を含有する水中付着生物防除剤は、長期にわたって防汚性、耐スライム性を与え、船舶、水中構造物に対する有害水中付着生物の付着及び繁殖防止に優れた効

果を発揮する。

本発明化合物を含有する水中付着生物防除剤は、通常塗料組成物として製剤し、使用されるが、場合によっては他の剤型(溶液、乳剤、ペレット等)に製剤し、使用することもできる。本発明化合物を塗料組成物として製剤する際に使用される塗料ビヒクルとしては、通常使用される樹脂ビヒクルが挙げられるが、例えば塩化ビニル系樹脂、塩化ビニルー酢酸ビニル共重合体、塩化ビニルービニルイソブチルエーテル共重合体、塩化ゴム系樹脂、塩素化ポリエチレン樹脂、塩素化ポリプロピレン樹脂、アクリル樹脂、スチレンーブタジエン系樹脂、ポリエステル系樹脂、エポキシ系樹脂、フェノール系樹脂、合成ゴム、シリコーンゴム、シリコーン系樹脂、石油系樹脂、油脂系樹脂、ロジンエステル系樹脂、ロジン系石鹼、ロジンなどが挙げられる。また防汚性を有するビヒクルとして、(メタ)アクリル酸とビス(トリブチルスズ)オキサイド、トリフェニルスズハイドロオキサイドのような有機スズ化合物との縮合反応で得られる不飽和モノもしくはジカルボン酸の有機スズ化合物塩を構成単位として含むアクリル共重合体樹脂組成物や、銅、亜鉛、テルルなどの金属元素を側鎖に含有する樹脂などを使用することもできる。

本発明化合物を塗料組成物として製剤する場合の配合割合は、塗料組成物全体に対し 0.1~60重量%、好ましくは1~40重量%の本発明化合物を含有するように製剤 調製される。

本発明化合物を含有する塗料組成物の調製は、塗料製造分野において周知である方法 に準じて、例えばボールミル、ペブルミル、ロールミル、サンドグライダーミルなどを 用いて行うことができる。また、前記塗料組成物は、通常当該分野で使用されている可 塑剤、着色顔料、体質顔料、有機溶剤などを含むことができる。

本発明化合物を含有する塗料組成物は、必要に応じ他の公知の無機または有機の防汚剤をさらに含有することができる。このような防汚剤としては、例えば亜酸化銅、ロダン化銅、水酸化銅、ナフテン酸銅、金属銅、各種のスズ化合物およびジチオカルバミン酸誘導体、例えばテトラメチルチウラムモノサルファイド、テトラメチルチウラムジサルファイド、ビスー(ジメチルジチオカルバミン酸) 亜鉛、エチレンービス(ジチオカルバミン酸) 亜鉛、エチレンービス(ジチオカルバミン酸) 亜鉛、エチレンービス(ジメチ

ルジチオカルバミン酸) 銅が挙げられる。

以上詳述したように、本発明化合物は有害生物防除剤の有効成分として有効であるが、 以下にその各態様をまとめて記載する。

- 〔1〕前記式(I)又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤又はそれら化合物を用いた有害生物の防除方法。
- [2] 前記式(I) 又はその塩を有効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤又は それら化合物を用いた農園芸分野における有害生物の防除方法。
- 〔3〕前記式(I)又はその塩を有効成分として含有する殺害虫剤又はそれら化合物を 用いた害虫の防除方法。
- 〔4〕前記式(I)又はその塩を有効成分として含有する殺虫剤又はそれら化合物を用いた有害昆虫の防除方法。
- 〔5〕前記式(I)又はその塩を有効成分として含有する殺ダニ剤又はそれら化合物を 用いたダニの防除方法。
- [6]前記式(I)又はその塩を有効成分として含有する殺線虫剤又はそれら化合物を 用いた線虫の防除方法。
- [7]前記式(I)又はその塩を有効成分として含有する殺土壌害虫剤又はそれら化合物を用いた土壌害虫の防除方法。
- [8] 前記式(I) 又はその塩を有効成分として含有する殺菌剤又はそれら化合物を用いた有害菌の防除方法。
- [9] 前記式(I) 又はその塩を有効成分として含有する水中付着生物防除剤又はそれら化合物を用いた水中付着生物の防除方法。

次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。まず 本発明化合物の合成例を記載する。

合成例1

 $\alpha - (4 - \text{tert} - \vec{\textit{T}} + \nu - \text{T} - \nu) - \beta - (5 - \rho - \text{DD} - 1 - \text{J} + \nu - 3 - \text{F} - \nu)$ フルオロメチルピラゾールー $4 - 4 - 4 - \nu$ $-\beta - (S - \text{J} + \nu + \nu + \nu + \nu + \nu + \nu + \nu)$ アクリロニトリル(後記化合物 No. 2 1 0)の合成

1) 4-(tert-ブチル) ベンジルシアニド1.0gと、5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-カルボン酸クロリド1.57gとをテトラヒドロフラン20mlに溶解させ、そこへカリウムtert-ブトキシド1.0gを 氷冷下で加えた。その後、室温にまで徐々に昇温させながら3時間反応させた。

反応終了後、反応溶液に水を加え、6 N-塩酸で溶液を酸性にした後酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後溶媒を減圧下で留去した。残渣をエタノール50mlに溶解させ、そこへ5%水酸化ナトリウム水溶液7mlを室温撹拌下で滴下した。次いで室温下で2時間撹拌し、エタノールを減圧下で留去した後、残渣にエーテルと水とを加えて抽出した。水層を6 N-塩酸でpH5に調整し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後溶媒を減圧下で留去し、α-(4-tert-ブチルフェニル)-β-(5-クロロ-1-メチルー3-トリフルオロメチルピラゾールー4-イル)-β-ヒドロキシアクリロニトリル1.4gを得た。

反応終了後、反応溶液に酢酸エチルと水とを加えて抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後溶媒を減圧下で留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:n − ヘキサン/酢酸エチル=9/1)にて精製して融点43.5℃の目的物0.35gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR δ ppm(solvent:CDCl_/400MHz):

1.35(s,9H),2.37(s,3H),3.80(s,3H),7.38(d,2H),7.50(d,2H)

合成例2

 $\alpha - (4 - t e r t - \vec{\tau} + \nu) - \beta - (5 - \rho - \rho - 1 - \lambda + \nu - 3 - \gamma)$

WO 99/44993 PCT/

フルオロメチルピラゾールー 4 ーイル) $-\beta$ ー (S ーメチルジチオカルボニルオキシ) アクリロニトリル (後記化合物 No. 2 1 5) の合成

26

1.30(s,9H),2.49(s,3H),3.89(s,3H),7.38(d,2H),7.51(d,2H)

合成例3

 $\alpha-(4-t\ e\ r\ t-プチルフェニル)-\beta-[エトキシ(チオカルボニル)オキシ]$ $-\beta-(3,\ 5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)アクリロニトリル(後記化合物 No. 419)の合成$

1) 3,5-ジメチルイソオキサゾールー4ーカルボニルクロリド0.5gをテトラヒドロフラン12mlに溶解させ、4-tert-ブチルベンジルシアニド0.6gを加えた後氷冷し、カリウムtert-ブトキシド0.63gを加え、室温に戻し1時間反応させた。

反応終了後、反応混合物を水中に投入し、塩化メチレンで抽出した。水層に塩酸を加え酸性とした後塩化メチレンで抽出し、得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後減圧濃縮して、油状の α - $(4-t\ e\ r\ t-)$ - γ -

PCT/JP99/01047 WO 99/44993

27

¹H-NMR δ ppm(solvent:CDCl₂/400MHz):

1.35(s,9H), 2.32(s,3H), 2.55(s,3H), 7.49(d,2H), 7.59(d,2H)

 $\alpha - (4 - t e r t - \vec{J} + \vec{$ チルイソオキサゾールー4ーイル)アクリロニトリル0.2g及びジクロロエタン5m 1の混合物にトリエチルアミン 0. 1 g を加えた後氷冷し、エチルクロロチオフォーメ ート 0. 1 2 g を加え、室温に戻し 3 時間反応させた。

反応終了後、反応混合物に水を加え塩化メチレンで抽出し、水洗した後有機層を無 水硫酸ナトリウムで乾燥した。次いで減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムク ロマトグラフィー (展開溶媒: nーヘキサン/酢酸エチル=4/1) にて精製して融点 93~94℃の目的物 0.2 gを得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通 りである。

¹H-NMR δ ppm(solvent:CDCl_/400MHz):

1.27(s,9H), 1.40(t,3H), 1.97(s,3H), 2.09(s,3H), 4.52(q,2H), 7.43(d,2H), 7.53(d,2H)合成例4

 $\alpha - (4 - t e r t - \vec{\tau} + \vec{\tau} + \vec{\tau}) - \beta - (3 - \rho u - 1 - \nu \rho u \vec{\tau} + \vec{\tau})$ ラゾールー4 ーイル) ーβー [(メチルチオ) カルボニルオキシ] アクリロニトリル (後 記化合物 No. 420及び421) の合成

3-クロロ-1-シクロプロピルピラゾール-4-カルボン酸0.95g及びジ 1) クロロエタン10mlの混合物に塩化チオニル0.73g及び触媒量のジメチルホルム アミドを加え、還流下で2時間反応させた。

反応終了後、反応混合物を減圧濃縮して3-クロロー1-シクロプロピルピラゾール ー4ーカルボニルクロリド0.95gを得た。

前工程で得た3-クロロー1-シクロプロピルピラゾールー4-カルボニルクロ リド0.5gを精製することなくテトラヒドロフラン10mlに溶解させ、4-ter tーブチルベンジルシアニド0.47gを加えた後氷冷し、カリウムtertーブトキ シド0. 49gを加え、室温に戻し1時間反応させた。

反応終了後、反応混合物を水中に投入し、塩化メチレンで洗浄した。水層に塩酸を

加え酸性とした後塩化メチレンで抽出し、得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後減圧濃縮して、油状の α – (4 – t e r t – プチルフェニル) – β – (3 – クロロー1 – シクロプロピルピラゾールー4 – イル) – β – ヒドロキシアクリロニトリル 0 . 4 5 g を得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR δ ppm(solvent:CDCl_/400MHz):

1.09(m,2H),1.15(m,2H),1.31(s,9H),3.56(m,1H),7.33(d,2H),7.42(d,2H),8.01(s,1H)

3) 前工程で得たαー(4ーtertーブチルフェニル)-βー(3ークロロー1ーシクロプロピルピラゾールー4ーイル)-βーヒドロキシアクリロニトリル 0.15g 及びジクロロエタン8 mlの混合物にトリエチルアミン58 mgを加えた後氷冷し、メチルクロロチオールフォーメート58 mgを加え、室温に戻して 0.5時間反応させた。反応終了後、反応混合物に水を加え、塩化メチレンで抽出した後水洗した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:nーヘキサン/酢酸エチル=85/15)にて精製して、油状の目的物(後記化合物 No.420)0.11g及び融点128~130℃の目的物(後記化合物 No.421)0.06gを各々得た。このもののNMRスペクトルデータは以下の通りである。

¹H-NMR δ ppm(solvent:CDCl_/400MHz):

化合物 No. 4 2 0

1.08(m,2H), 1.20(m,2H), 1.33(s,9H), 2.32(s,3H), 3.62(m,1H), 7.44(d,2H), 7.49(d,2H), 8.15(s,1H)

化合物 No. 4 2 1

0.93(m,4H),1.29(s,9H),2.42(s,3H),3.41(m,1H),7.06(s,1H),7.24(d,2H),7.36(d,2H)

次に、前記式(I)で表される本発明化合物の代表例を第1表に挙げるが、これら化合物は前記合成例或は前記した本発明化合物の種々の製造方法に基づいて合成することができる。

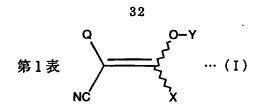
尚、第1表で用いられる略号は、各々以下の意味を示す。

Me:メチル基、Et:エチル基、Pr:プロピル基、Bu:ブチル基、Pen:ペン

チル基、Hex:ヘキシル基、Ph:フェニル基、t:ターシャリー、Cy:シクロ

PCT/JP99/01047

また、ベンジル(4-Cl)は、4-クロロベンジル基を示す。他の同様の記載も これに準じる。



化合物No	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
1	Q 1	-COSMe	X 1	油状
2	Q 1	-COSEt	X 2	油状
3	Q1	-CSOMe	X 4	147~149 ℃
4	Q1	-CSOEt	X 5	
5	Q1	-CSOPh	X 10	·· - · - · · · · · · · · · · · · · · ·
6	Q1	-CS ₂ Me	X 11	
7	Q 1	-CS ₂ Et	X12	
8	Q1	-COSMe	X 3	95~98℃
9	Q1	-COSEt	X 3	
10	Q1	-CSOMe	Х3	
11	Q1	-CSOEt	Х3	88~90℃
12	Q 1	-CSOPh	Х3	
13	Q 1	-CS ₂ Me	Х3	
14	Q 1	-CS ₂ Et	Х3	
15	Q 1	-CH2CH=CH2	Х3	
16	Q 1	-COSMe	X 6	
17	Q 1	-COSEt	X 6	
18	Q 1	-CS ₂ Me	X 6	
19	Q 1	-CS₂Et	X 6	
20	Q 1	-CH ₂ C≣CI	X 6	
21	Q 1	-COSMe	X 7	146~148 ℃
22	Q 1	-COSEt	X 7	油状
23	Q1	-CS2Me	X 7	n _D 48.6 1.5926
24	Q 1	-CS₂Et	X 7	n _D 47.8 1.6291

第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
25	Q 1	-COCH₂C≡CH	X 7	
26	Q1	-COSMe	X 8	90~93℃
27	Q 1	-COSEt	X 8	92~93℃
28	Q1	-CSOMe	X 8	
29	Q1	-CSOEt	X 8	
30	Q1	-CSOPh	X 8	
31	Q 1	-CS ₂ Me	X 8	アモルファス
32	Q 1	-CS ₂ Et	X 8	n _D 48.2 1.6119
33	Q1	-COSCH ₂ CF ₃	X 8	
34	Q1	-COSMe	X 9	68∼71℃
35	Q1	-COSEt	X 9	油状
36	Q 1	-CSOMe	X 9	
37	Q 1	-CSOEt	X 9	
38	Q 1	-CSOPh	X 9	96∼98℃
39	Q 1	-CS₂Me	X 9	45.3 ℃
40	Q 1	-CS ₂ Et	X 9	
41	Q 1	-COSCH ₂ CN	X 9	
42	Q 1	-COSMe	X 13	
43	Q 1	-COSEt	X 13	
44	Q 1	-CS ₂ Me	X 13	
45	Q 1	-CS ₂ Et	X 13	
46	Q1	-COS(CH ₂) ₂ N(Me) ₂	X 13	
47	Q1	-COSMe	X 18	
48	Q 1	-COSEt	X 18	
49	Q 1	-CS₂Me	X 18	
50	Q 1	-CS ₂ Et	X 18	

34

第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
51	Q1	-COSCH ₂ CH=CH ₂	X 18	
52	Q 1	-COSMe	X21	
53	Q1	-COSEt	X21	
54	Q1	-CS ₂ Me	X21	
55	Q1	-CS ₂ Et	X21	
56	Q 1	-cosch₂c≡ch	X 21	
57	Q1	-COSMe	X 24	
58	Q1	-COSEt	X24	
59	Q1	-CS ₂ Me	X24	
60	Q1	-CS ₂ Et	X24	
61	Q1	-COS-CyPr	X24	
62	Q1	-COSMe	X27	
63	Q 1	-COSEt	X27	
64	Q1	-CS₂Me	X 27	
65	Q 1	-CS ₂ Et	X 27	
66	Q 1	-COS-^*ンジル(4-Cl)	X 27	
67	Q1	-COSMe	X 30	
68	Q 1	-COSEt	X 30	
69	Q 1	-CS₂Me	X 30	
70	Q 1	-CS₂Et	X 30	
71	Q 1	-COS-2-ピリジル	X 30	
72	Q 1	-COSMe	X 33	
73	Q 1	-COSEt	X 33	
74	Q 1	-CS2Me	X 33	
75	Q 1	-CS₂Et	X 33	
76	Q 1	-COS-2-ピリジル(5-CFs)	X 33	

35 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
77	Q 1	-COSMe	X 36	
78	Q 1	-COSEt	X 36	
79	Q 1	-CS ₂ Me	X 36	
80	Q1	-CS₂Et	X 36	
81	Q1	-CSMe	X 36	
82	Q 2	-COSMe	X 14	
83	Q 2	-COSEt	X 15	
84	Q 2	-CSOMe	X 16	
85	Q 2	-CSOEt	X 17	
86	Q 2	-CSOPh	X 19	
87	Q 2	-CS2Me	X 20	
88	Q 2	-CS ₂ Et	X 22	
89	Q 2	-COSMe	X 3	E体 104~105 ℃
90	Q 2	-COSMe	X 3	Z体 123~125 ℃
91	Q 2	-COSEt	X 3	
92	Q 2	-CS ₂ Me	Х3	
93	Q 2	-CS ₂ Et	Х3	
94	Q 2	-COSMe	X 6	
95	Q 2	-COSEt	X 6	
96	Q 2	-CS ₂ Me	X 6	
97	Q 2	-CS ₂ Et	X 6	
98	Q 2	-CSOCH₂CH=CH(OCH₃)	X 6	
99	Q 2	-COSMe	X 7	111∼112 ℃
100	Q 2	-COSEt	X 7	
101	Q 2	-CS ₂ Me	X 7	
102	Q 2	-CS₂Et	X 7	

36 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
103	Q 2	-csoch₂c≡ch	X 7	
104	Q 2	-COSMe	X 8	87~89℃
105	Q 2	-COSEt	X 8	
106	Q 2	-CS₂Me	X 8	
107	Q 2	-CS₂Et	X 8	
108	Q 2	-CS ₂ CH ₂ CO ₂ Et	X 8	
109	Q 2	-COSMe	X 9	油状
110	Q 2	-COSEt	X 9	
111	Q 2	-CS ₂ Me	X 9	
112	Q 2	-CS ₂ Et	X 9	
113	Q 2	-CS2CH2CH=CCl2	X 9	
114	Q 2	-COSMe	X 13	
115	Q 2	-COSEt	X 13	
116	Q 2	-CS ₂ Me	X 13	
117	Q 2	-CS ₂ Et	X 13	
118	Q 2	−CS ₂ CH ₂ C≡COMe	X 13	
119	Q 2	-COSMe	X 18	
120	Q 2	-COSEt	X 18	
121	Q 2	-CS ₂ Me	X 18	
122	Q 2	-CS ₂ Et	X 18	
123	Q 2	-CS-CyHex	X 18	
124	Q 2	-COSMe	X21	
125	Q 2	-COSEt	X21	
126	Q 2	-CS ₂ Me	X21	
127	Q 2	-CS ₂ Et	X21	
128	Q 2	-CSO-CyPen	X21	

37 第1表 (続き)

化合物Na	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
129	Q 2	-COSMe	X24	
130	Q 2	-COSEt	X24	
131	Q 2	-CS₂Me	X24	
132	Q 2	-CS₂Et	X 24	
133	Q 2	-CS ₂ -CyPr	X24	
134	Q 2	-COSMe	X27	
135	Q 2	-COSEt	X27	
136	Q 2	-CS2Me	X27	
137	Q 2	-CS₂Et	X27	
138	Q 2	-CS-Ph(2-Me)	X 27	
139	Q 2	-COSMe	X 30	
140	Q 2	-COSEt	X 30	
141	Q 2	-CS2Me	X 30	
142	Q 2	-CS₂Et	X 30	
143	Q 2	-CSO-Ph(4-CF ₃)	X 30	
144	Q 2	-COSMe	X 33	
145	Q 2	-COSEt	X 33	
146	Q 2	-CS ₂ Me	X 33	
147	Q 2	-CS ₂ Et	X 33	
148	Q 2	-CS ₂ -Ph(4-CN)	X 33	
149	Q 2	-COSMe	X 36	
150	Q 2	-COSEt	X 36	
151	Q 2	-CS ₂ Me	X 36	
152	Q 2	-CS₂Et	X 36	
153	Q 2	-CS-^*ンジル(4-tBu)	X 36	
154	Q 3	-COSMe	Х3	

38 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
155	Q3	-COSEt	X 3	
156	Q 3	-CSOMe	X 3	
157	Q 3	-CSOEt	X 3	
158	Q 3	-CSOPh	Х3	
159	Q 3	-CS ₂ Me	X 3	
160	Q 3	-CS₂Et	Х3	
161	Q 3	-COSMe	X 8	
162	Q 3	-COSEt	X 8	
163	Q 3	-CSOMe	X 8	
164	Q 3	-CSOEt	X 8	
165	Q 3	-CSOPh	X 8	
166	Q 3	-CS ₂ Me	X 8	
167	Q 3	-CS ₂ Et	X 8	
168	Q 3	-COSMe	X 9	94~96℃
169	Q 3	-COSEt	X 9	
170	Q 3	-CSOMe	X 9	
171	Q 3	-CSOEt	X 9	
172	Q 3	-CSOPh	X 9	
173	Q 3	-CS ₂ Me	X 9	
174	Q 3	-CS ₂ Et	X 9	
175	Q 4	-COSMe	X 23	
176	Q 4	-COSEt	X 25	
177	Q 4	-CSOMe	X 26	
178	Q 4	-CSOEt	X 28	
179	Q 4	-CSOPh	X 29	
180	Q 4	-CS₂Me	X 31	

39 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
181	Q 4	-CS2Et	X 32	
182	Q 4	-COSMe	X 34	
183	Q 4	-CS ₂ Me	X 35	
184	Q 4	-COSMe	Х3	87~88℃
185	Q 4	-COSEt	Х3	油状
186	Q 4	-CSOMe	X 3	
187	Q 4	-CSOEt	Х3	油状
188	Q 4	-CSOPh	X 3	
189	Q 4	-CS2Me	X 3	
190	Q 4	-CS ₂ Et	X 3	
191	Q 4	-CSO-^゙ンジル(4-SO ₂ Me)	Х3	
192	Q 4	-COSMe	X 6	
193	Q 4	-COSEt	X 6	
194	Q 4	-CS₂Me	X 6	
195	Q4	-CS₂Et	X 6	
196	Q 4	-CS ₂ -^*ンジル(4-NO ₂)	X 6	
197	Q 4	-COSMe	X 7	油状
198	Q 4	-COSEt	X 7	油状
199	Q 4	-CS ₂ Me	X 7	53.4 ℃
200	Q 4	-CS ₂ Et	X 7	
201	Q 4	-CS-2-ピリジル	X 7	
202	Q 4	-COSMe	X 8	109∼113 ℃
203	Q 4	-COSEt	X 8	油 状
204	Q 4	-CSOMe	X 8	
205	Q 4	-CSOEt	X 8	油状
206	Q 4	-CSOPh	X 8	

40 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
207	Q 4	-CS₂Me	X 8	52.2 ℃
208	Q 4	-CS ₂ Et	X 8	
209	Q 4	-CS-2-+1=N	X 8	
210	Q 4	-COSMe	X 9	43.5 ℃
211	Q 4	-COSEt	X 9	油状
212	Q 4	-CSOMe	X 9	
213	Q 4	-CSOEt	X 9	油状
214	Q 4	-CSOPh	X 9	55∼57℃
215	Q 4	-CS ₂ Me	X 9	50.9 ℃
216	Q 4	-CS ₂ Et	X 9	
217	Q 4	-CS-7-キノリル	X 9	
218	Q 4	-COSMe	X 13	
219	Q 4	-COSEt	X 13	
220	Q 4	-CS2Me	X 13	
221	Q 4	-CS ₂ Et	X 13	
222	Q 4	-CSO-2-ピリジル	X 13	
223	Q 4	-COSMe	X 18	
224	Q 4	-COSEt	X 18	
225	Q 4	-CS2Me	X 18	
226	Q 4	-CS₂Et	X 18	
227	Q 4	-CSO-5-ピラン゚リル(1-Me)	X 18	
228	Q 4	-COSMe	X 21	
229	Q 4	-COSEt	X 21	
230	Q 4	-CS2Me	X 21	•
231	Q 4	-CS₂Et	X21	
232	Q 4	-CSO-2-7IIN	X21	

41 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
233	Q 4	-COSMe	X 24	
234	Q 4	-COSEt	X 24	
235	Q 4	-CS2Me	X 24	
236	Q 4	-CS₂Et	X 24	
237	Q 4	-CS2-2-ピリジル	X 24	
238	Q 4	-COSMe	X 27	
239	Q 4	-COSEt	X 27	
240	Q 4	-CS ₂ Me	X 27	
241	Q 4	-CS₂Et	X 27	
242	Q 4	-CS ₂ -5-ピラン゙リル(1-Me)	X 27	
243	Q 4	-COSMe	X 30	
244	Q 4	-COSEt	X 30	
245	Q 4	-CS ₂ Me	X 30	
246	Q 4	-CS ₂ Et	X 30	
247	Q 4	-CS2-2-FI_N	X 30	
248	Q 4	-COSMe	X 33	
249	Q 4	-COSEt	X 33	
250	Q 4	-CS ₂ Me	X 33	
251	Q 4	-CS2Et	X 33	
252	Q 4	-COSCH ₂ CF ₃	X 33	
253	Q 4	-COSMe	X 36	
254	Q 4	-COSEt	X 36	
255	Q 4	-CS ₂ Me	X 36	
256	Q 4	-CS ₂ Et	X 36	
257	Q 4	-COSCH ₂ CN	X36	
258	Q 5	-COSMe	X 6	

__

42 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
259	Q 5	-COSEt	X 6	
260	Q 5	-CSOMe	X 6	
261	Q 5	-CSOEt	X 6	
262	Q 5	-CSOPh	X 6	
263	Q 5	-CS₂Me	X 6	
264	Q 5	-CS ₂ Et	X 6	
265	Q 5	-COSMe	X 7	98~100 ℃
266	Q 5	-COSEt	X 7	
267	Q 5	-CSOMe	X 7	
268	Q 5	-CSOEt	X 7	
269	Q 5	-CSOPh	X 7	
270	Q 5	-CS2Me	X 7	
271	Q 5	-CS ₂ Et	X 7	
272	Q 5	-COSMe	X 13	
273	Q 5	-COSEt	X 13	
274	Q 5	-CSOMe	X 13	
275	Q 5	-CSOEt	X 13	
276	Q 5	-CSOPh	X 13	
277	Q 5	-CS ₂ Me	X 13	
278	Q 5	-CS ₂ Et	X 13	
279	Q 6	-COSMe	X 18	
280	Q 6	-COSEt	X 18	
281	Q6	-CSOMe	X 18	
282	Q6	-CSOEt	X 18	
283	Q6	-CSOPh	X 18	
284	Q6	-CS₂Me	X 18	

43 第1表 (続き)

化合物Na	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
285	Q 6	-CS ₂ Et	X 18	
286	Q 6	-COSMe	X21	
287	Q 6	-COSEt	X 21	
288	Q 6	-CSOMe	X21	
289	Q 6	-CSOEt	X 21	
290	Q6	-CSOPh	X21	
291	Q6	-CS₂Me	X 21	
292	Q 6	-CS₂Et	X21	
293	Q 7	-COSMe	X 24	
294	Q 7	-COSEt	X 24	
295	Q 7	-CSOMe	X 24	
296	Q 7	-CSOEt	X 24	
297	Q 7	-CSOPh	X 24	
298	Q 7	-CS ₂ Me	X 24	
299	Q 7	-CS ₂ Et	X 24	
300	Q 7	-COSMe	X27	
301	Q 7	-COSEt	X 27	
302	Q 7	-CSOMe	X27	
303	Q 7	-CSOEt	X27	
304	Q 7	-CSOPh	X 27	
305	Q 7	-CS2Me	X27	
306	Q 7	-CS ₂ Et	X 27	
307	Q 8	-COSMe	X 30	
308	Q 8	-COSEt	X 30	····_
309	Q 8	-CSOMe	X 30	
310	Q 8	-CSOEt	X 30	

44 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
	Q8	-CSOPh	X 30	7711(成杰/加州十)
311	 			
312	Q 8	-CS ₂ Me	X 30	
313	Q 8	-CS ₂ Et	X 30	
314	Q 8	-COSMe	X 33	
315	Q 8	-COSEt	X 33	
316	Q 8	-CSOMe	X 33	
317	Q 8	-CSOEt	X 33	
318	Q8	-CSOPh	X 33	
319	Q 8	-CS ₂ Me	X 33	_
320	Q 8	-CS₂Et	X 33	
321	Q 9	-COSMe	X36	
322	Q 9	-COSEt	X 36	
323	Q 9	-CSOMe	X 36	
324	Q 9	-CSOEt	X 36	
325	Q9	-CSOPh	X 36	
326	Q 9	-CS ₂ Me	X 36	
327	Q 9	-CS₂Et	X36	
328	Q1	-COSEt	X 1	油状
329	Q1	-CSOEt	X 1	
330	Q 1	-COSMe	X 2	油状
331	Q 1	-CSOEt	X 2	油状
332	Q 1	-CSOEt	X 7	
333	Q 1	-COSMe	X 11	油状
334	Q 1	-COSEt	X 11	油状
335	. Q 1	-CSOEt	X 11	油状
336	Q 1	-COSMe	X12	

45 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
337	Q1	-COSEt	X 12	
338	Q1	-CSOEt	X 12	
339	Q1	-COSMe	X35	
340	Q1	-COSEt	X 35	
341	Q 1	-CSOEt	X 35	
342	Q1	-COSMe	X37	油状
343	Q1	-COSEt	X 37	72∼74℃
344	Q1	-CS ₂ Me	X37	油状
345	Q1	-COSMe	X38	E体 155~158 ℃
346	Q1	-COSMe	X 38	Z体 油 状
347	Q1	-COSEt	X38	油状
348	Q 1	-CS ₂ Me	X 38	油状
349	Q 1	-COSMe	X 39	油状
350	Q 1	-COSEt	X39	油状
351	Q1	-COSMe	X 40	油状
352	Q 1	-CS₂Et	X43	n _D 35.4 1.5508
353	Q 1	-COSMe	X 44	np34.0 1.5730
354	Q1	-CS₂Me	X 44	48.2 ℃
355	Q 1	-COSMe	X45	
356	Q 1	-COSEt	X45	
357	Q1	-CSOEt	X 45	
358	Q 1	-COSMe	X46	
359	Q 1	-COSEt	X 46	
360	Q 1	-CSOEt	X 46	
361	Q 1	-COSMe	X47	
362	Q 1	-COSEt	X 47	

46 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
363	Q1	-CSOEt	X47	
364	Q1	-COSMe	X 48	
365	Q 1	-COSEt	X 48	
366	Q 1	-CSOEt	X 48	
367	Q 1	-COSMe	X 49	
368	Q1	-COSEt	X 49	
369	Q 1	-CSOEt	X 49	
370	Q 1	-COSMe	X 50	
371	Q1	-COSEt	X 50	
372	Q 1	-CSOEt	X 50	
373	Q 1	-COSMe	X 51	
374	Q1	-COSEt	X 51	
375	Q1	-CSOEt	X51	
376	Q1	-COSMe	X 52	
377	Q 1	-COSEt	X 52	
378	Q 1	-CSOEt	X 52	
379	Q1	-COSMe	X 53	
380	Q 1	-COSEt	X 53	
381	Q 1	-CSOEt	X 53	
382	Q 1	-CS2Me	X 54	
383	Q 1	-CS ₂ Et	X 56	
384	Q 1	-CS ₂ Et	X 59	
385	Q1	-CS2Me	X 60	
386	Q 1	-COSMe	X 64	
387	Q 1	-COSEt	X 64	
388	Q 1	-CSOEt	X 64	

47 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
389	Q 2	-COSMe	X 4	124~126 ℃
390	Q 2	-CS₂Et	X 62	
391	Q 2	-CS2Me	X 63	
392	Q 4	-COSMe	X 1	油状
393	Q 4	-COSEt	X 1	油 状
394	Q 4	-CSOEt	X 1	122∼124 ℃
395	Q 4	-COSMe	X 2	油状
396	Q 4	-COSEt	X 2	油 状
397	Q 4	-CSOEt	X 2	110∼112 ℃
398	Q 4	-COSMe	X 4	油状
399	Q 4	-COSEt	X 4	油状
400	Q 4	-CSOEt	X 7	油状
401	Q 4	-COSMe	X 11	油状
402	Q 4	-COSEt	X 11	油状
403	Q 4	-CSOEt	X 11	油状
404	Q 4	-COSMe	X 12	
405	Q 4	-COSEt	X 12	
406	Q 4	-CSOEt	X 12	
407	Q 4	-COSMe	X 35	
408	Q 4	-COSEt	X 35	
409	Q 4	-CSOEt	X 35	
410	Q 4	-COSMe	X37	油、状
411	Q 4	-COSEt	X37	61~62℃
412	Q 4	-CS2Me	X 37	56.8 ℃
413	Q 4	-COSMe	X 38	E体 115~117 ℃
414	Q 4	-COSMe	X 38	Z体 油 状

48 第1表 (続き)

			·	
化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
415	Q 4	-COSEt	X 38	E体 油 状
416	Q 4	-CS ₂ Et	X 38	油状
417	Q 4	-COSMe	X 39	油状
418	Q 4	-COSEt	X39	油状
419	Q 4	-CSOEt	X 39	93~94℃
420	Q 4	-COSMe	X40	E体 油 状
421	Q 4	-COSMe	X 40	Z体 128~130 ℃
422	Q 4	-COSMe	X41	油状
423	Q 4	-COSMe	X 42	90∼91℃
424	Q 4	-COSMe	X 44	n _D 34.2 1.5582
425	Q 4	-CS₂Me	X 44	56.7 ℃
426	Q 4	-COSMe	X 45	
427	Q 4	-COSEt	X45	
428	Q 4	-CSOEt	X45	
429	Q 4	-COSMe	X46	
430	Q 4	-COSEt	X 46	
431	Q 4	-CSOEt	X46	
432	Q 4	-COSMe	X47	
433	Q 4	-COSEt	X47	
434	Q 4	-CSOEt	X 47	
435	Q 4	-COSMe	X48	
436	Q 4	-COSEt	X48	
437	Q 4	-CSOEt	X48	
438	Q 4	-COSMe	X49	
439	Q 4	-COSEt	X 49	
440	Q 4	-CSOEt	X 49	

49 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	Х	物性(融点/屈折率)
441	Q 4	-COSMe	X 50	
442	Q 4	-COSEt	X 50	
443	Q 4	-CSOEt	X 50	
444	Q 4	-COSMe	X51	
445	Q 4	-COSEt	X 51	
446	Q 4	-CSOEt	X 51	
447	Q 4	-COSMe	X 52	
448	Q 4	-COSEt	X 52	
449	Q 4	-CSOEt	X 52	
450	Q 4	-COSMe	X 53	
451	Q 4	-COSEt	X 53	
452	Q 4	-CSOEt	X 53	
453	Q 4	-CS ₂ Me	X 55	
454	Q 4	-CS₂Et	X 61	
455	Q 4	-COSMe	X 64	
456	Q 4	-COSEt	X 64	
457	Q 4	-CSOEt	X 64	
458	Q 5	-COSMe	X 8	87∼91℃
459	Q 5	-COSEt	X 8	油状
460	Q 5	-COSMe	X 9	np31.8 1.5318
461	Q 5	-COSEt	X 9	油状
462	Q 5	-CS2Me	X 9	n _D 28.0 1.5704
463	Q 5	-CS ₂ Et	X57	
464	Q 5	-CS ₂ Me	X 58	
465	Q10	-COSMe	X 7	86∼88℃
466	Q10	-COSMe	X 8	88∼90℃

50 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
467	Q11	-COSMe	X 1	
468	Q11	-CSOEt	X 2	
469	Q12	-COSMe	X 3	
470	Q12	-CSOEt	X 7	
471	Q 13	-COSMe	X 8	
472	Q13	-CSOEt	X 9	
473	Q14	-COSMe	X 11	
474	Q14	-CSOEt	X 12	
475	Q15	-COSMe	X 1	
476	Q15	-CSOEt	X 2	
477	Q16	-COSMe	Х3	
478	Q16	-CSOEt	X 7	
479	Q17	-COSMe	X 8	
480	Q17	-CSOEt	X 9	
481	Q18	-COSMe	X 11	
482	Q18	-CSOEt	X 12	
483	Q19	-COSMe	X 9	油状
484	Q19	-COSEt	X 9	
485	Q19	-CSOEt	X 9	
486	Q20	-COSMe	X 1	
487	Q20	-COSEt	X 2	
488	Q20	-CSOEt	Х3	
489	Q20	-COSMe	X 7	
490	Q20	-COSEt	X 8	
491	Q20	-COSMe	X 9	133~137 ℃
492	Q20	-COSEt	X 9	,

51 第1表 (続き)

化合物No	Q	Y	X	物性(融点/屈折率)
493	Q20	-CSOEt	X 9	
494	Q20	-COSMe	X 11	
495	Q20	-COSEt	X 12	
496	Q21	-COSMe	Х9	
497	Q21	-COSEt	X9	
498	Q21	-CS₂Me	Х9	
499	Q21	-CS₂Et	Х9	
500	Q21	-CSOMe	Х9	
501	Q21	-CSOEt	Х9	
502	Q21	-COSMe	X8	
503	Q21	-COSMe	X7	
504	Q22	-COSMe	Х9	
505	Q23	-COSEt	Х9	
506	Q24	-COSMe	Х9	
507	Q25	-COSMe	Х9	
508	Q25	-CS ₂ Me	X8	
509	Q25	-CSOMe	X7	
510	Q25	-COSMe	X8	
511	Q25	-CS2Me	Х9	
512	Q26	-COSMe	Х9	
513	Q27	-COSMe	Х9	
514	Q27	-COSMe	Х8	
515	Q28	-COSMe	Х9	
516	Q29	-COSMe	Х9	

次に試験例を記載する。

試験例1 ナミハダニ殺成虫試験

本発明化合物の濃度が 800ppm となるように調製した薬液を準備した。インゲンマメの初生業1枚だけを残したものをカップ(直径 8cm、高さ 7cm)に移植し、これにナミハダニの成虫約 30 頭を接種した。このものをインゲン葉とともに、前記薬液に約10 秒間浸漬し、風乾後 26℃の照明付恒温室内に放置した。処理後 2 日目に生死を判定し、下記計算式により殺成虫率を求めた。

殺成虫率(%)=死虫数/放虫数×100

その結果、前記化合物 No. 1~3、8、11、21~24、26、27、31、32、34、35、38、39、89、99、104、109、168、184、185、187、197~199、202、203、207、210、211、213~215、265、328、330、331、333~335、349~351、389、392、393、395~399、401~403、417~420、422、423、458~462、465、466及び491が各々90%以上の殺成虫率を示した。

試験例2 ナミハダニ殺卵試験

本発明化合物の濃度が 800ppm となるように調製した薬液を準備した。インゲンマメの初生葉 1 枚だけを残したものをカップ(直径 8cm、高さ 7cm)に移植し、これにナミハダニの成虫を接種し、24 時間産卵させ、成虫を取り除いた。このものをインゲン葉とともに、前記薬液に約 10 秒間浸漬し、風乾後 26℃の照明付恒温室内に放置した。処理後 7 日目に卵の孵化状況を調査し、下記計算式により殺卵率を求めた。

殺卵率(%)=殺卵数/産卵数×100

その結果、前記化合物 No. 1~3、8、11、21~24、26、27、31、32、34、35、38、39、89、99、104、109、168、184、185、187、197~199、202、203、207、210、211、213~215、265、328、330、331、333~335、349~351、389、392、393、395~399、401~403、417~420、422、423、458~462、465、466及び491が各々90%以上の殺卵率を示した。

WO 99/44993

53

試験例3 ヒメトビウンカ殺虫試験

本発明化合物の濃度が 800ppm となるように調製した薬液にイネ幼苗を約 10 秒間浸 潰し、風乾後湿った脱脂綿で根部を包んで試験管に入れる。次いで、この中ヘヒメトビ ウンカの幼虫 10 頭を放ち、管口にガーゼでふたをして 26℃の照明付恒温室内に放置す る。その後虫の生死を判定すると、本発明化合物は有効な防除効果を示す。

試験例4 モモアカアプラムシ殺虫試験

本発明化合物の濃度が 800ppm となるように調製した薬液を準備した。本葉 1 枚の みを残したポット (直径 8cm、高さ 7cm) 植えナスの葉柄に粘着剤を塗布した後、そ の本葉にモモアカアブラムシ無翅胎生雌成虫を2~3頭接種し、産仔させた。接種 2 日後成虫を除去し、幼虫数をかぞえた。この幼虫の寄生したナス葉を前記薬液に約10 秒間浸漬処理し、風乾後 26℃の照明付恒温室内に放置した。処理後 5 日目に生死を判 定し、下記計算式により死虫率を求めた。なお離脱虫は死亡したものとみなした。

死虫率(%)=死虫数/処理時幼虫数×100

その結果、前記化合物 No. 2 6 、 3 4 、 1 0 9 及び 4 6 5 が各々90%以上の死虫率を 示した。

試験例5 コナガ殺虫試験

本発明化合物の濃度が 800ppm となるように調製した薬液にキャベツの葉片を約 10 秒間浸漬し、風乾する。直径 9cm のペトリ皿に湿った濾紙を敷き、その上に風乾した 葉片を置く。そこへ 2~3 令のコナガ幼虫 10 頭を放ち、ふたをして 26℃の照明付恒温 室内に放置する。その後虫の生死を判定すると、本発明化合物は有効な防除効果を示す。 トマト疫病予防効果試験 試験例 6

直径 7.5cm のポリ鉢でトマト (品種:ポンテローザ) を栽培し、4 葉期に達した時 に本発明化合物が 500ppm となるように調製した薬液 10ml をスプレーガンを用いて 散布する。薬液が乾燥した後、疫病菌の遊走子襄懸濁液を噴霧接種し、20℃の恒温室 内に保つ。その後病斑面積を調査すると、本発明化合物は有効な防除効果を示す。

試験例7 コムギうどんこ病予防効果試験

直径 7.5cm のポリ鉢でコムギ (品種:農林 61 号) を栽培し、1.5 葉期に達した時に

20重量部

本発明化合物が 500ppm となるように調製した薬液 10ml をスプレーガンを用いて散布する。薬液が乾燥した後、うどんこ病菌の分生胞子を振り掛け接種し、20℃の恒温室内に保つ。その後胞子形成面積を調査すると、本発明化合物は有効な防除効果を示す。試験例 8 エンバク冠さび病予防効果試験

直径 7.5cm のポリ鉢でエンバク (品種:前進)を栽培し、1.5 葉期に達した時に本発明化合物が 500ppm となるように調製した薬液 10ml をスプレーガンを用いて散布する。薬液が乾燥した後、冠さび病菌の分生胞子を振り掛け接種する。その後胞子形成面積を調査すると、本発明化合物は有効な防除効果を示す。

試験例9 緑藻類防除試験

本発明化合物の濃度が100ppmとなるように調製した薬液を含む藻類生育用培地に、 予め7日間かけて培養した緑藻(①Selenastrum capricornutum または②Chlorella vulgaris)を接種し、照明下20℃の恒温室内で8日間放置した後緑藻の生育程度を調査すると、本発明化合物は有効な防除効果を示す。

次に製剤例を記載する。

(1) 本発明化合物

製剤例1

(1) 1 30 31 6 6 7	DO王里IIP
(2) クレー	72重量部
(3) リグニンスルホン酸ソーダ	8重量部
以上のものを均一に混合して水和剤とする。	
製剤例 2	
(1) 本発明化合物	5重量部
(2) タルク	9 5 重量部
以上のものを均一に混合して粉剤とする。	
製剤例3	
(1) 本発明化合物	20重量部
(2) N, N' ージメチルアセトアミド	20重量部
(3) ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル	10重量部

PCT/JP99/01047

(4) キシレン 50重量部

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

製剤例4

(1) クレー 68重量部

(2) リグニンスルホン酸ソーダ 2 重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルアリールサルフェート 5 重量部

(4) 微粉シリカ 25重量部

以上の各成分の混合物と、本発明化合物とを4:1の重量割合で混合し、水和剤とする。

製剤例5

(1) 本発明化合物 50重量部

(2) オキシレーテッドポリアルキルフェニルフォスフェートートリエタノールアミン

2重量部

(3) シリコーン 0. 2重量部

(4) 水 47.8重量部

以上のものを均一に混合、粉砕した原液に更に

(5) ポリカルボン酸ナトリウム 5重量部

(6) 無水硫酸ナトリウム 42.8重量部

を加え均一に混合、乾燥して顆粒水和剤とする。

製剤例6

(1) 本発明化合物 5 重量部

(2) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル 1 重量部

(3) ポリオキシエチレンの燐酸エステル 0.1 重量部

(4) 粒状炭酸カルシウム 93.5重量部

(1)~(3)を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、(4)に吹付け、 アセトンを除去して粒剤とする。

製剤例7

(1) 本発明化合物

2. 5重量部

56

(2) N-メチル-2-ピロリドン

2. 5 重量部

(3) 大豆油

95.0重量部

以上のものを均一に混合、溶解して微量散布剤 (ultra low volume formulation) とする。

製剤例8

(1) 本発明化合物

5重量部

(2) N, N' -ジメチルアセトアミド

15重量部

(3) ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル

10重量部

(4) キシレン

70重量部

以上のものを均一に混合し乳剤とする。

製剤例9

(1) 本発明化合物

4 0 重量部

(2) オキシレーテッドポリアルキルフェノールフォスフェートートリエタノールアミ

ン

2重量部

(3) シリコン

0.2重量部

(4) ザンサンガム

0.1重量部

(5) エチレングリコール

5重量部

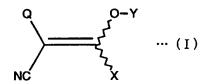
(6)水

52.7重量部

以上のものを均一に混合、粉砕して水性懸濁剤とする。

57 請求の範囲

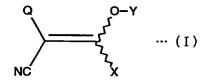
1. 式(I);



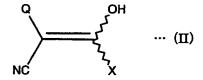
[式中、Qは置換されてもよいフェニル、置換されてもよいベンジル、置換されてもよ いナフチル又はーIであり、Xは置換されてもよいナフチル又は一Iであり、Yはアル ケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、-C (=O) R,又は-C (=S) R, であり、R, は置換されてもよいアルキニル又は-SR, であり、R, は置換さ れてもよいアルキル、置換されてもよいアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置 換されてもよいアルコキシ、置換されてもよいアルケニルオキシ、置換されてもよいア ルキニルオキシ、置換されてもよいアルキルチオ、置換されてもよいアルケニルチオ、 置換されてもよいアルキニルチオ、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよ いシクロアルキルオキシ、置換されてもよいシクロアルキルチオ、置換されてもよいフ ェニル、置換されてもよいフェノキシ、置換されてもよいフェニルチオ、置換されても よいペンジル、置換されてもよいペンジルオキシ、置換されてもよいペンジルチオ、一 J、-O-J又は-S-Jであり、R,は置換されてもよいアルキル、置換されてもよ いアルケニル、置換されてもよいアルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換 されてもよいベンジル又は-Jであり、JはO、S及びNからなる群より選ばれた少な くとも1種の原子を1~4含有する5若しくは6員複素環基(複素環基は置換されてい てもよい)又はO、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~10 含有する6~11員縮合複素環基(縮合複素環基は置換されていてもよい)であり、但 しXはピリジル基を含まない〕で表されるアクリロニトリル系化合物又はその塩。 2. 」の複素環基がピロリル、フリル、チエニル、イミダブリル、ピラブリル、オキサ

 Jの複素環基がピロリル、フリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサ ゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3ートリアゾリル、 1, 2, 4ートリアゾリル、1, 2, 3ーオキサジアゾリル、1, 2, 4ーオキサジア ゾリル、1, 3, 4ーオキサジアゾリル、1, 2, 3ーチアジアゾリル、1, 2, 4ー チアジアゾリル、1,3,4ーチアジアゾリル、1,2,3,4ーテトラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、1,2,4ートリアジニル、1,3,5ートリアジニル、1,2,4,5ーテトラジニル、イミダゾリニル、ピラブリニル、オキサゾリニル、イソオキサゾリニル、チアゾリニル、インチアゾリニル、1ーピロリジニル、1ーピペリジニル又は4ーモルホリノであり、縮合複素環基がインドリル、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾイミダブリル、インダゾリル、ベンゾオキサブリル、ベンゾイソキサブリル、ベンブチアブリル、ベンブインチアブリル、ベンブインチアブリル、マンブチアブリル、ボンブインチアブリル、キノリル、カンノリル、フタラジル、キナザリニル又はキノキサリニルである請求項1のアクリロニトリル系化合物又はその塩。

3. 式(I);



されてもよいベンジル又は一」であり、Jは〇、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~4含有する5若しくは6員複素環基(複素環基は置換されていてもよい)又は〇、S及びNからなる群より選ばれた少なくとも1種の原子を1~10含有する6~11員縮合複素環基(縮合複素環基は置換されていてもよい)であり、但しXはピリジル基を含まない〕で表されるアクリロニトリル系化合物又はその塩の製造方法であって、式(II):



[式中、Q及びXは前述の通りである]で表される化合物と式(III);

$$Y - L \cdots (III)$$

〔式中、Yは前述の通りであり、Lはハロゲンである〕で表される化合物を反応させる ことを特徴とする方法。

- 4. 請求項1のアクリロニトリル系化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。
- 5. 請求項1のアクリロニトリル系化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫、 殺ダニ又は殺線虫剤。
- 6. 請求項1のアクリロニトリル系化合物又はその塩を有効成分として有害生物に作用 させることを特徴とする有害生物の防除方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP99/01047

Int.	A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁶ C07D231/12, 231/16, 231/20, 233/64, 233/68, 261/08, 261/10, 263/32, 263/34, 275/02, 275/03, 277/24, 277/32, 403/12, 417/12, According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC				
	to International Patent Classification (IPC) or to both OS SEARCHED	national classification and IPU			
Minimum o	documentation searched (classification system followe	ed by classification symbols)			
Int	.C1° C07D231/12, 231/16, 231/3 263/32, 263/34, 275/02, 2	20, 233/64, 233/68, 261 75/03, 277/24, 277/32, 4	403/12, 417/12,		
Documenta	tion searched other than minimum documentation to t	the extent that such documents are include	ed in the fields searched		
Electronic of CAPI	data base consulted during the international search (na LUS (STN), REGISTRY (STN)	ame of data base and, where practicable, so	earch terms used)		
C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
Category*	Citation of document, with indication, where a	· -	Relevant to claim No.		
X A	US, 4988818, A (BASF Aktien 29 January, 1991 (29. 01. 91	gesellschaft),	1-3		
Α.	Claims; column 3, line 55 t & EP, 421267, A2 & CA, 202	to column 4, line 12	4-6		
A	WO, 97/40009, Al (Nissan Chem 30 October, 1997 (30. 10. 97 & EP, 913392, Al	1-6			
PA	WO, 98/35935, Al (Ishihara 20 August, 1998 (20. 08. 98) & AU, 5879998, A	1-6			
PA	WO, 98/42683, A1 (Nippon So 1 October, 1998 (01. 10. 98) & AU, 6420498, A		1-6		
PA	JP, 10-158254, (Ihara Chemic 16 June, 1998 (16. 06. 98)	al Industry Co., Ltd.), (Family: none)	1-6		
	r documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.			
"A" docume	categories of cited documents: ant defining the general state of the art which is not	"T" later document published after the interns date and not in conflict with the applicati	ion but cited to understand		
consider "E" earlier d	red to be of particular relevance socument but published on or after the international filing date	the principle or theory underlying the inv "X" document of particular relevance; the cla	vention		
"L" docume	ent which may throw doubts on priority claim(s) or which is establish the publication date of another citation or other	considered novel or cannot be considered when the document is taken alone			
special r	reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the cla			
means	nt referring to an oral disclosure, use, exhibition or other	considered to involve an inventive step w combined with one or more other such do	ocuments, such combination		
	P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "&" document member of the same patent family				
	Date of the actual completion of the international search 31 May, 1999 (31. 05. 99) Date of mailing of the international search report 15 June, 1999 (15. 06. 99)				
	ailing address of the ISA/ nese Patent Office	Authorized officer			
Facsimile No	.	Telephone No.			

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP99/01047

A. (Continuation) CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A01N43/56, 43/80

B. (Continuation) FIELDS SEARCHED

A01N43/56, 43/80

Form PCT/ISA/210 (extra sheet) (July 1992)

発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. C1° C07D231/12, 231/16, 231/20, 233/64, 233/68, 261/08, 2 61/10, 263/32, 263/34, 275/02, 275/03, 277/24, 277/32, 403/1 2, 417/12, A01N43/56, 43/80

調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. C1° C07D231/12, 231/16, 231/20, 233/64, 233/68, 261/08, 2 61/10, 263/32, 263/34, 275/02, 275/03, 277/24, 277/32, 403/1 2, 417/12, A01N43/56, 43/80

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語) CAPLUS (STN)

REGISTRY (STN)

	3と認められる文献	
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	US, 4988818, A, (BASF Aktiengesellschaft), 29. 1月. 1991 (29. 01. 91), クレーム及び第3欄 第55行〜第4欄第12行&EP, 421267, A2&CA, 2 027039, A	1 - 3 $4 - 6$
A	WO, 97/40009, A1, (日産化学工業株式会社), 30.10月.1997 (30.10.97) & EP, 91339 2, A1	1 — 6
PA	WO, 98/35935, A1, (石原産業株式会社), 20. 8月. 1998 (20. 08. 98) & AU, 5879998, A	1-6

|X| C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

- * 引用文献のカテゴリー
- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示す もの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日 以後に公安されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行 日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する 文献 (理由を付す)
- 「〇」口頭による開示、使用、展示等に営及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

- の日の後に公表された文献
- 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって て出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理 論の理解のために引用するもの
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明 の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以 上の文献との、当業者にとって自明である組合せに よって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

31.05.99

国際調査報告の発送日

15.06.99

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官(権限のある職員) 内田 淳子

4 P 8115

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP99/01047

			LINE TO LOTATE	9/01047
	C (続き). 引用文献の	関連すると認められる文献		
	カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときに	関連する 請求の範囲の番号	
	PA	WO, 98/42683, A1, (日本曹 0月. 1998 (01. 10. 98) & A	いたサートへという	1-6
	PA			
	- 11	JP, 10-158254, (イハラケミ 16.06.1998 (16.06.98	カル工業株式会社),)(ファミリーなし)	1-6
ı				
				1
۱		·		1
ĺ				
l				1
			1	
				j
			į	
				j
				1
				İ
_				
ͺ	+non /			